



Rx. Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

SUTRIPIN 50/SUTRIPIN 100

Viên nén bao phim Sumatriptan 50 mg/100 mg

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

Để xa tầm tay trẻ em

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc

THÀNH PHẦN VÀ HÀM LƯỢNG

Mỗi viên nén bao phim có chứa:

Hoạt chất:

Viên nén bao phim Sumatriptan 50 mg:

Sumatriptan (dưới dạng Sumatriptan succinate)50 mg.

Viên nén bao phim Sumatriptan 100 mg:

Sumatriptan (dưới dạng Sumatriptan succinate) 100 mg.

Tá dược vừa đủ: Anhydrous dibasic calcium phosphate, microcrystalline cellulose 102, sodium bicarbonate, croscarmellose sodium, magnesium stearate, Colorcoat FC4WS – H (thành phần: hydroxy propyl methyl cellulose (5 cps), hydroxy propyl methyl cellulose (15 cps), precipitated silica, dibutyl sebacate, talcum, titanium dioxide).

DẠNG BÀO CHẾ

Viên nén bao phim Sumatriptan 50 mg: Viên nén bao phim màu trắng, bóng láng, không bong hay dính chữ, hình tam giác (hình triangle), hai mặt khum, một mặt được dập chìm chữ “HERA”, một mặt trơn láng, cạnh và thành viên lành lặn.

Viên nén bao phim Sumatriptan 100 mg: Viên nén bao phim màu trắng, bóng láng, không bong hay dính chữ, hình thoi (hình diamond), hai mặt khum, một mặt được dập chìm chữ “HERA”, một mặt trơn láng, cạnh và thành viên lành lặn.

CHỈ ĐỊNH

Sumatriptan được chỉ định để điều trị cấp tính các cơn đau nửa đầu có hoặc không có triệu chứng ở người lớn.

Hạn chế sử dụng:

- Chỉ sử dụng khi đã chẩn đoán rõ ràng chứng đau nửa đầu. Nếu bệnh nhân không đáp ứng khi dùng sumatriptan cho cơn đau nửa đầu đầu tiên, cần xem xét lại chẩn đoán chứng đau nửa đầu trước khi dùng sumatriptan để điều trị những cơn đau tiếp theo.
- Sumatriptan không được chỉ định để ngăn ngừa các cơn đau nửa đầu.
- Chưa xác định tính an toàn và hiệu quả của sumatriptan đối với đau đầu chùm.

LIỀU DÙNG VÀ CÁCH DÙNG

Liều dùng

Liều khuyến cáo của sumatriptan là 25 mg, 50 mg hoặc 100 mg. Liều 50 mg và 100 mg có thể có hiệu quả hơn liều 25 mg, nhưng liều 100 mg có thể không có hiệu quả hơn liều 50 mg. Liều cao hơn có thể tăng nguy cơ gây ra tác dụng không mong muốn.

Nếu không thuyên giảm chứng đau nửa đầu sau 2 giờ uống sumatriptan hoặc tái phát sau khi có cải thiện thoáng qua, có thể dùng liều thứ hai sau liều đầu tiên tối thiểu 2 giờ. Liều dùng tối đa hàng ngày là 200 mg trong 24 giờ.

Sử dụng sau khi tiêm sumatriptan

Nếu chứng đau nửa đầu quay trở lại sau khi điều trị ban đầu bằng tiêm sumatriptan, có thể dùng thêm các liều sumatriptan (tối đa 100 mg/ngày) với khoảng cách giữa các lần dùng thuốc ít nhất 2 giờ.

Chưa xác định tính an toàn khi điều trị trung bình hơn 4 cơn đau đầu trong khoảng thời gian 30 ngày.

Liều dùng cho bệnh nhân suy gan

Nếu cần phải điều trị khi có suy gan nhẹ đến vừa, liều duy nhất tối đa không được vượt quá 50 mg.

Cách dùng

Uống nguyên viên thuốc với nước.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

- Bệnh động mạch vành (CAD) thiếu máu cục bộ (đau thắt ngực, tiền sử nhồi máu cơ tim hoặc thiếu máu cục bộ thâm lặn được ghi nhận) hoặc co thắt động mạch vành, bao gồm đau thắt ngực Prinzmetal.
- Hội chứng Wolff-Parkinson-White hoặc rối loạn khác liên quan đến rối loạn đường dẫn truyền phụ trong tim.
- Tiền sử đột quỵ hoặc cơn thiếu máu não thoáng qua (TIA) hoặc tiền sử liệt nửa người hoặc bệnh nền đau nửa đầu vì những bệnh nhân này có nguy cơ đột quỵ cao hơn.
- Bệnh lý mạch máu ngoại biên.
- Bệnh thiếu máu cục bộ ở ruột.
- Tăng huyết áp không kiểm soát được.
- Mới sử dụng thuốc chứa ergotamine (trong vòng 24 giờ), thuốc loại ergot (như dihydroergotamine hoặc methysergide) hoặc chất chủ vận 5-hydroxytryptamine (5-HT₁) khác.
- Phối hợp với chất ức chế monoamine oxidase (MAO) – A hoặc gần đây (trong vòng 2 tuần) có sử dụng chất ức chế MAO – A.
- Quá mẫn với sumatriptan (đã quan sát thấy phù mạch và phản vệ).
- Suy gan nặng.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Thiếu máu cục bộ cơ tim, nhồi máu cơ tim và đau thắt ngực Prinzmetal

Chống chỉ định sumatriptan ở bệnh nhân CAD bị thiếu máu cục bộ hoặc co thắt mạch máu. Hiếm gặp các phản ứng bất lợi trên tim, gồm nhồi máu cơ tim cấp tính, xảy ra trong vòng vài giờ sau khi dùng sumatriptan. Một số phản ứng xảy ra ở những bệnh nhân không biết mắc CAD. Sumatriptan có thể gây co thắt động mạch vành (đau thắt ngực Prinzmetal), ngay cả ở những bệnh nhân không có tiền sử CAD.

Thực hiện đánh giá tình trạng tim mạch ở những bệnh nhân chưa từng dùng triptan nhưng có nhiều yếu tố nguy cơ tim mạch (như tuổi cao, đái tháo đường, tăng huyết áp, hút thuốc,

béo phì, tiền sử gia đình có bệnh CAD) trước khi dùng sumatriptan. Chống chỉ định sumatriptan nếu có triệu chứng của bệnh CAD hoặc co thắt động mạch vành. Đối với những bệnh nhân có nhiều yếu tố nguy cơ tim mạch được đánh giá tiêu cực về tim mạch, cần nhắc sử dụng liều sumatriptan đầu tiên ở nơi được giám sát y tế và thực hiện điện tâm đồ (ECG) ngay sau khi dùng sumatriptan. Đối với những bệnh nhân này, cần xem xét đánh giá tim mạch định kỳ khi sử dụng trong thời gian dài nhưng không liên tục.

Rối loạn nhịp tim

Đã ghi nhận rối loạn nhịp tim đe dọa tính mạng, bao gồm nhịp nhanh thất và rung thất dẫn đến tử vong trong vài giờ sau khi sử dụng chất chủ vận 5-HT₁. Ngừng sumatriptan nếu xảy ra những rối loạn này. Chống chỉ định sumatriptan ở những bệnh nhân mắc hội chứng Wolff-Parkinson-White hoặc rối loạn nhịp tim liên quan đến rối loạn đường dẫn truyền phụ trong tim khác.

Đau/căng tức/áp lực ở ngực, họng, cổ và/hoặc hàm

Cảm giác căng tức, đau, áp lực và nặng nề ở vùng trước tim, họng, cổ và hàm thường xảy ra sau khi dùng sumatriptan và thường không có nguồn gốc từ tim. Tuy nhiên, thực hiện đánh giá tình trạng tim nếu những bệnh nhân này có nguy cơ mắc bệnh tim cao. Chống chỉ định sumatriptan ở những bệnh nhân CAD và những người bị đau thắt ngực Prinzmetal.

Biến cố mạch máu não

Đã xảy ra xuất huyết não, xuất huyết dưới màng nhện và đột quỵ ở những bệnh nhân điều trị bằng chất chủ vận 5-HT₁ và một số đã tử vong. Trong một số trường hợp, dường như các biến cố mạch máu não là nguyên phát, sử dụng chất chủ vận 5-HT₁ với niềm tin sai lầm rằng các triệu chứng gặp phải là hậu quả của chứng đau nửa đầu trong khi thực tế không phải như vậy. Ngoài ra, bệnh nhân bị đau nửa đầu có thể tăng nguy cơ mắc một số biến cố mạch máu não (như đột quỵ, xuất huyết, TIA). Ngừng sumatriptan nếu xảy ra tai biến mạch máu não.

Trước khi điều trị đau đầu ở những bệnh nhân chưa từng được chẩn đoán là đau nửa đầu và những người đau nửa đầu có triệu chứng không điển hình, phải loại trừ các bệnh thần kinh nghiêm trọng khác. Chống chỉ định sumatriptan ở những bệnh nhân có tiền sử đột quỵ hoặc TIA.

Các phản ứng co thắt mạch

Sumatriptan có thể gây ra các phản ứng co thắt mạch không liên quan đến mạch vành, như thiếu máu cục bộ mạch máu ngoại biên, thiếu máu cục bộ mạch máu đường tiêu hóa và nhồi máu đường tiêu hóa (với biểu hiện đau bụng và tiêu chảy ra máu), nhồi máu lách và hội chứng Raynaud. Ở những bệnh nhân có các triệu chứng hoặc dấu hiệu gợi ý phản ứng co thắt mạch không liên quan đến mạch vành sau khi sử dụng bất kỳ chất chủ vận 5-HT₁ nào, phải loại trừ phản ứng co thắt mạch máu trước khi dùng thêm sumatriptan.

Đã ghi nhận các trường hợp mù thoáng qua hoặc vĩnh viễn và mất thị lực một phần đáng kể khi sử dụng chất chủ vận 5-HT₁. Vì rối loạn thị giác có thể là một phần của cơn đau nửa đầu nên chưa xác định rõ ràng mối quan hệ nhân quả giữa những triệu chứng này và việc sử dụng chất chủ vận 5-HT₁.

Lạm dụng thuốc đau đầu

Lạm dụng thuốc đau nửa đầu cấp tính (như ergotamine, triptan, opioid hoặc kết hợp các loại thuốc này trong 10 ngày trở lên mỗi tháng) có thể dẫn đến đau đầu trầm trọng hơn (đau đầu do lạm dụng thuốc). Đau đầu do lạm dụng thuốc có thể biểu hiện giống như đau nửa đầu hằng ngày hoặc tăng rõ rệt tần suất các cơn đau nửa đầu.

Quá trình cai thuốc cho bệnh nhân, bao gồm cả việc ngừng sử dụng các loại thuốc đã lạm dụng và có thể cần điều trị các triệu chứng cai thuốc (thường bao gồm cơn đau đầu trầm trọng hơn thoáng qua).

Hội chứng serotonin

Hội chứng serotonin có thể xảy ra với sumatriptan, đặc biệt khi dùng đồng thời với thuốc ức chế tái hấp thu serotonin có chọn lọc (SSRI), thuốc ức chế tái hấp thu serotonin norepinephrine (SNRI), thuốc chống trầm cảm ba vòng (TCA) và thuốc ức chế MAO. Các triệu chứng của hội chứng serotonin có thể bao gồm thay đổi trạng thái tinh thần (như kích động, ảo giác, hôn mê), hệ thần kinh thực vật mất ổn định (như nhịp tim nhanh, huyết áp không ổn định, tăng thân nhiệt), sự bất thường trong hệ thống thần kinh-cơ (như tăng phản xạ, mất phối hợp) và/hoặc các triệu chứng đường tiêu hóa (như buồn nôn, nôn, tiêu chảy). Các triệu chứng thường bắt đầu xảy ra trong vòng vài phút đến vài giờ sau khi nhận được một liều thuốc serotonergic mới hoặc liều cao hơn. Ngừng sumatriptan nếu nghi ngờ có hội chứng serotonin.

Tăng huyết áp

Tăng huyết áp đáng kể, bao gồm cơn tăng huyết áp với suy giảm cấp tính của các hệ cơ quan, đã được báo cáo trong một số trường hợp hiếm gặp ở những bệnh nhân được điều trị bằng chất chủ vận 5-HT₁, kể cả những bệnh nhân không có tiền sử tăng huyết áp. Theo dõi huyết áp ở bệnh nhân điều trị bằng sumatriptan. Chống chỉ định sumatriptan ở bệnh nhân tăng huyết áp không kiểm soát được.

Phản ứng phản vệ

Đã xảy ra phản ứng phản vệ ở những bệnh nhân dùng sumatriptan. Những phản ứng này có thể đe dọa tính mạng hoặc gây tử vong. Nói chung, có nhiều khả năng xảy ra phản ứng phản vệ ở những người có tiền sử nhạy cảm với nhiều tác nhân dị ứng. Chống chỉ định sumatriptan ở những bệnh nhân có tiền sử phản ứng quá mẫn với sumatriptan.

Co giật

Đã có báo cáo co giật sau khi dùng sumatriptan. Một số trường hợp xảy ra ở những bệnh nhân có tiền sử co giật hoặc đang trong những tình trạng có thể dẫn đến co giật. Cũng có những báo cáo ở bệnh nhân không có yếu tố nguy cơ rõ ràng. Nên thận trọng khi sử dụng sumatriptan ở những bệnh nhân có tiền sử động kinh hoặc các tình trạng liên quan đến ngưỡng co giật thấp.

Đối tượng đặc biệt:

Trẻ em

Chưa xác định được tính an toàn và hiệu quả ở trẻ em. Không khuyến cáo sử dụng sumatriptan cho bệnh nhân dưới 18 tuổi.

Người cao tuổi

Các thử nghiệm lâm sàng về sumatriptan không có đủ số lượng bệnh nhân từ 65 tuổi trở lên để xác định họ có đáp ứng khác so với bệnh nhân trẻ hơn hay không.

Các báo cáo về kinh nghiệm lâm sàng khác không xác định được sự khác biệt trong đáp ứng giữa bệnh nhân là người cao tuổi và đối tượng trẻ hơn. Nhìn chung, cần phải thận trọng khi chọn liều dùng cho bệnh nhân cao tuổi, thường bắt đầu ở mức thấp nhất trong phạm vi liều điều trị, phản ánh tần suất giảm chức năng gan, thận, tim và bệnh nền hoặc thuốc dùng đồng thời.

Khuyến cáo đánh giá tim mạch cho bệnh nhân cao tuổi có các yếu tố nguy cơ tim mạch khác (đái tháo đường, tăng huyết áp, hút thuốc, béo phì, tiền sử gia đình mắc CAD) trước khi dùng sumatriptan.

Suy gan

Liều duy nhất tối đa ở những bệnh nhân suy gan nhẹ đến vừa không được vượt quá 50 mg. Chống chỉ định sumatriptan ở bệnh nhân suy gan nặng.

Tá dược

Sản phẩm chứa ít hơn 1 mmol natri (23 mg) mỗi viên, nghĩa là về cơ bản “không chứa natri”.

SỬ DỤNG THUỐC CHO PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ

Trong thai kỳ:

Dữ liệu từ cơ quan đăng ký về tiếp xúc với sumatriptan trong thai kỳ trong tương lai và các nghiên cứu dịch tễ học về phụ nữ mang thai không phát hiện thấy tần suất dị tật bẩm sinh gia tăng hoặc một dạng dị tật bẩm sinh đồng nhất ở những phụ nữ tiếp xúc với sumatriptan so với dân số chung. Trong các nghiên cứu về độc tính phát triển ở chuột và thỏ, việc cho động vật mang thai uống sumatriptan có liên quan đến hiện tượng chết phôi, dị tật thai nhi và tử vong ở con non. Khi dùng đường tiêm tĩnh mạch cho thỏ mang thai, sumatriptan gây chết phôi.

Trong nhóm người Hoa Kỳ nói chung, nguy cơ cơ bản ước tính về các dị tật bẩm sinh nghiêm trọng và sảy thai ở những trường hợp mang thai được công nhận về mặt lâm sàng lần lượt là 2% đến 4% và 15% đến 20%. Tỷ lệ dị tật bẩm sinh nghiêm trọng được báo cáo ở những phụ nữ bị chứng đau nửa đầu được báo cáo là từ 2,2% đến 2,9% và tỷ lệ sảy thai được báo cáo là 17%, tương tự như tỷ lệ được báo cáo ở phụ nữ không bị chứng đau nửa đầu.

Cân nhắc trên lâm sàng

Nguy cơ liên quan đến bệnh của mẹ và/hoặc phôi thai/thai nhi

Một số nghiên cứu cho thấy phụ nữ bị chứng đau nửa đầu có thể tăng nguy cơ tiền sản giật khi mang thai.

Thời kỳ cho con bú:

Sumatriptan được bài tiết vào sữa mẹ sau khi tiêm dưới da.

Không có thông tin liên quan đến nồng độ sumatriptan trong sữa của phụ nữ đang cho con bú sau khi dùng sumatriptan. Không có dữ liệu về tác dụng của sumatriptan đối với trẻ bú mẹ hoặc tác dụng của sumatriptan đối với sự tạo thành sữa.

Nên xem xét các lợi ích về sức khỏe và sự tiến triển khi cho con bú cùng với nhu cầu lâm sàng của người mẹ đối với sumatriptan và bất kỳ tác dụng không mong muốn tiềm ẩn nào đối với trẻ sơ sinh bú sữa mẹ do sumatriptan hoặc do bệnh nền của người mẹ.

Cân nhắc trên lâm sàng

Có thể giảm thiểu việc tiếp xúc với sumatriptan ở trẻ sơ sinh bằng cách tránh cho con bú trong 12 giờ sau khi dùng sumatriptan.

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE, VẬN HÀNH MÁY MÓC

Sumatriptan có thể gây chóng mặt, suy nhược hoặc buồn ngủ. Nếu xuất hiện những triệu chứng này, không nên lái xe, vận hành máy móc hoặc làm bất cứ việc gì cần sự tỉnh táo.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG Kỵ CỦA THUỐC

Thuốc có chứa ergot

Các thuốc chứa ergot đã được báo cáo là gây ra phản ứng co thắt mạch máu kéo dài. Vì những tác dụng này có thể là tác dụng không mong muốn, nên chống chỉ định sử dụng các loại thuốc có chứa ergotamine hoặc loại ergot (như dihydroergotamine hoặc methysergide) và sumatriptan trong vòng 24 giờ với nhau.

Chất ức chế monoamine oxidase-A

Thuốc ức chế MAO-A làm tăng nồng độ toàn thân gấp 7 lần. Do đó, chống chỉ định sử dụng sumatriptan ở những bệnh nhân đang dùng thuốc ức chế MAO-A.

Các chất chủ vận 5-HT₁ khác

Vì tác dụng co thắt mạch của thuốc có thể là tác dụng không mong muốn, nên chống chỉ định sử dụng đồng thời sumatriptan và các chất chủ vận 5-HT₁ khác (như triptan) trong vòng 24 giờ với nhau.

Thuốc ức chế tái hấp thu serotonin có chọn lọc/thuốc ức chế tái hấp thu serotonin norepinephrine và hội chứng serotonin

Các trường hợp mắc hội chứng serotonin đã được báo cáo khi dùng đồng thời triptan và SSRI, SNRI, TCA và thuốc ức chế MAO.

Tương kỵ

Do không có các nghiên cứu về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN

Các tác dụng không mong muốn sau đây đã được trình bày chi tiết hơn trong các phần khác của tờ hướng dẫn sử dụng:

- Thiếu máu cục bộ cơ tim, nhồi máu cơ tim và đau thắt ngực Prinzmetal
- Rối loạn nhịp tim
- Đau/căng tức/áp lực ở ngực, họng, cổ và/hoặc hàm
- Biến cố mạch máu não
- Các phản ứng co thắt mạch khác
- Lạm dụng thuốc đau đầu
- Hội chứng serotonin
- Tăng huyết áp
- Phản ứng phản vệ

– Co giật

Kinh nghiệm từ những thử nghiệm lâm sàng:

Vì các thử nghiệm lâm sàng được tiến hành trong các điều kiện rất khác nhau nên tỷ lệ tác dụng không mong muốn quan sát được trong các thử nghiệm lâm sàng của một loại thuốc không thể so sánh trực tiếp với tỷ lệ trong các thử nghiệm lâm sàng của một loại thuốc khác và có thể không phản ánh tỷ lệ quan sát được trong thực tế.

Bảng 1 liệt kê các tác dụng không mong muốn xảy ra trong các thử nghiệm lâm sàng có đối chứng với giả dược ở những bệnh nhân dùng ít nhất 1 liều thuốc nghiên cứu. Chỉ các tác dụng không mong muốn phát sinh trong quá trình điều trị xảy ra với tần suất từ 2% trở lên ở bất kỳ nhóm nào điều trị bằng viên nén bao phim sumatriptan và xảy ra với tần suất cao hơn nhóm giả dược mới được đưa vào bảng 1.

Bảng 1: Các tác dụng không mong muốn được báo cáo bởi ít nhất 2% bệnh nhân điều trị bằng viên nén bao phim sumatriptan và có tần suất cao hơn nhóm giả dược.

Tác dụng không mong muốn	Tỷ lệ phần trăm bệnh nhân báo cáo			
	Viên nén bao phim Sumatriptan 25 mg (n = 417)	Viên nén bao phim Sumatriptan 50 mg (n = 771)	Viên nén bao phim Sumatriptan 100 mg (n = 437)	Giả dược (n = 309)
Cảm giác không điển hình	5	6	6	4
Dị cảm (tất cả các loại)	3	5	3	2
Cảm giác nóng/lạnh	3	2	3	2
Cảm giác đau và áp lực khác	6	6	8	4
Đau/căng tức/áp lực và/hoặc nặng ngực	1	2	2	1
Đau/căng tức/áp lực ở cổ/họng/hàm	< 1	2	3	< 1
Xác định vị trí đau	2	1	1	1
Cảm giác áp lực/căng tức/nặng khác	1	1	3	2
Thần kinh	< 1	< 1	2	< 1
Chóng mặt				
Khác				
Khó chịu/mệt mỏi	2	2	3	< 1

Tỷ lệ các tác dụng không mong muốn trong các thử nghiệm lâm sàng có đối chứng không bị ảnh hưởng bởi giới tính hoặc tuổi của bệnh nhân. Không có đủ dữ liệu để đánh giá ảnh hưởng của chủng tộc đến tỷ lệ tác dụng không mong muốn.

Kinh nghiệm sau khi đưa thuốc ra thị trường:

Các tác dụng không mong muốn sau đây đã được xác định trong quá trình sử dụng sumatriptan dưới dạng viên nén bao phim, thuốc xịt mũi và thuốc tiêm sau khi đưa thuốc ra thị trường. Vì những tác dụng không mong muốn này được báo cáo một cách tự nguyện từ một quần thể không rõ quy mô nên không phải lúc nào cũng có thể ước tính tần suất của

chúng một cách đáng tin cậy hoặc thiết lập mối quan hệ nhân quả với việc dùng thuốc. Những tác dụng không mong muốn này được chọn để đưa vào do mức độ nghiêm trọng, tần suất được báo cáo hoặc mối liên hệ nhân quả với sumatriptan hoặc sự kết hợp của các yếu tố này.

Tim mạch: Hạ huyết áp, đánh trống ngực.

Thần kinh: Rối loạn trương lực cơ, run.

Tùy theo mức độ nghiêm trọng của tác dụng không mong muốn trên lâm sàng ở từng bệnh nhân, bác sĩ xem xét đưa ra quyết định ngưng thuốc và xây dựng phác đồ điều trị phù hợp.

Bệnh nhân thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc.

Báo cáo các phản ứng có hại của thuốc về Trung tâm Thông tin thuốc và Theo dõi phản ứng có hại của thuốc.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Trong các thử nghiệm lâm sàng, bệnh nhân (N = 670) được uống liều duy nhất từ 140 mg đến 300 mg mà không có tác dụng không mong muốn đáng kể. Những người tình nguyện (N = 174) được uống liều duy nhất từ 140 mg đến 400 mg mà không có tác dụng không mong muốn nghiêm trọng nào.

Quá liều ở động vật đã gây tử vong và được báo trước bởi co giật, run, tê liệt, không hoạt động, sa mi mắt, ban đỏ ở tứ chi, hô hấp bất thường, tím tái, mất điều hòa, giãn đồng tử, tiết nước bọt và chảy nước mắt.

Thời gian bán thải của sumatriptan là khoảng 2,5 giờ và do đó, nên tiếp tục theo dõi bệnh nhân sau khi dùng quá liều sumatriptan trong ít nhất 12 giờ hoặc trong khi các triệu chứng hay dấu hiệu vẫn còn.

Chưa biết chạy thận nhân tạo hoặc thẩm phân phúc mạc có ảnh hưởng gì đến nồng độ sumatriptan trong huyết thanh không.

DƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: Thuốc chống đau nửa đầu, thuốc chủ vận chọn lọc serotonin (5-HT₁).

Mã ATC: N02CC01.

Cơ chế tác dụng:

Sumatriptan liên kết ái lực cao với thụ thể 5-HT_{1B/1D} nhân bản của người. Sumatriptan có thể phát huy tác dụng trong điều trị chứng đau nửa đầu thông qua tác dụng chủ vận ở các thụ thể 5-HT_{1B/1D} trên các mạch máu nội sọ và các dây thần kinh cảm giác của dây thần kinh sinh ba, dẫn đến co thắt mạch máu sọ và ức chế giải phóng neuropeptide tiền viêm.

Tác dụng dược lực học:

Huyết áp

Tăng huyết áp đáng kể, kể cả cơn tăng huyết áp, đã được báo cáo ở những bệnh nhân có và không có tiền sử tăng huyết áp.

Động mạch (nhỏ) ngoại biên

Ở những người tình nguyện khỏe mạnh (N = 18), một thử nghiệm đánh giá tác dụng của sumatriptan đối với phản ứng động mạch (mạch máu nhỏ) ngoại vi đã không phát hiện ra sự gia tăng đáng kể về mật lâm sàng đối với sức cản ngoại vi.

Nhịp tim

Quan sát thấy tăng huyết áp thoáng qua ở một số bệnh nhân trong các thử nghiệm lâm sàng được thực hiện trong quá trình phát triển sumatriptan như một phương pháp điều trị chứng đau nửa đầu không đi kèm với bất kỳ thay đổi đáng kể nào về mặt lâm sàng đối với nhịp tim.

DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu

Nồng độ tối đa trung bình sau khi uống liều 25 mg sumatriptan là 18 ng/mL (7 đến 47 ng/mL) và sau khi uống 100 mg sumatriptan là 51 ng/mL (28 đến 100 ng/mL). Điều này so sánh với C_{max} là 5 và 16 ng/mL sau khi dùng tương ứng liều 5 và 20 mg đường trong mũi. C_{max} trung bình sau khi tiêm dưới da 6 mg là 71 ng/mL (49 đến 110 ng/mL). Sinh khả dụng xấp xỉ 15%, chủ yếu do chuyển hóa trước khi vào tuần hoàn và một phần do hấp thu không hoàn toàn. C_{max} tương tự trong cơn đau nửa đầu và trong thời gian không đau nửa đầu, nhưng T_{max} muộn hơn một chút trong cơn đau nửa đầu, khoảng 2,5 giờ so với 2,0 giờ. Khi dùng một liều duy nhất, sumatriptan thể hiện tỷ lệ liều với mức độ hấp thu (diện tích dưới đường cong (AUC)) trong khoảng liều từ 25 đến 200 mg, nhưng C_{max} sau khi dùng 100 mg thấp hơn khoảng 25% so với dự kiến (dựa trên liều 25 mg).

Ảnh hưởng của thức ăn

Một thử nghiệm về ảnh hưởng của thức ăn liên quan đến sử dụng sumatriptan 100 mg cho những người tình nguyện khỏe mạnh khi đói và khi dùng cùng một bữa ăn giàu chất béo, cho thấy C_{max} và AUC đã tăng lên lần lượt là 15% và 12% khi sử dụng lúc no.

Phân bố

Liên kết với protein, được xác định bằng thẩm tách trạng thái cân bằng trong khoảng nồng độ từ 10 đến 1 000 ng/mL là thấp, khoảng 14% đến 21%. Chưa đánh giá tác dụng của sumatriptan đối với sự gắn kết với protein của các thuốc khác. Thể tích phân bố biểu kiến là 2,7 L/kg.

Chuyển hóa

Các nghiên cứu *in vitro* với microsom người cho thấy sumatriptan được chuyển hóa bởi MAO, chủ yếu là isoenzym A. Hầu hết liều sumatriptan được đánh dấu phóng xạ bài tiết qua nước tiểu là chất chuyển hóa chính indole acetic acid (IAA) hoặc IAA glucuronide, cả hai đều không có hoạt tính.

Thải trừ

Thời gian bán thải của sumatriptan khoảng 2,5 giờ. Sumatriptan đánh dấu phóng xạ ^{14}C dùng đường uống chủ yếu được bài tiết qua thận (khoảng 60%) và khoảng 40% được tìm thấy trong phân. Hầu hết hợp chất được đánh dấu phóng xạ bài tiết qua nước tiểu là chất chuyển hóa chính, IAA hoặc glucuronide IAA không có hoạt tính. Chỉ 3% liều dùng được tìm thấy dưới dạng sumatriptan không đổi.

Các đối tượng đặc biệt

Tuổi

Dược động học của sumatriptan ở người cao tuổi (tuổi trung bình: 72 tuổi, 2 nam và 4 nữ) và ở các đối tượng mắc chứng đau nửa đầu (tuổi trung bình: 38 tuổi, 25 nam và 155 nữ) tương tự như ở các đối tượng nam khỏe mạnh (tuổi trung bình: 30 tuổi).

Suy thận

Chưa nghiên cứu ảnh hưởng của suy thận đối với dược động học của sumatriptan.

Suy gan

Gan đóng vai trò quan trọng trong quá trình thanh thải sumatriptan dùng đường uống trước khi vào tuần hoàn. Theo đó, sinh khả dụng của sumatriptan sau khi uống có thể tăng rõ rệt ở bệnh nhân mắc bệnh gan. Trong một thử nghiệm nhỏ ở bệnh nhân suy gan vừa ($n = 8$) phù hợp về giới tính, tuổi tác và cân nặng với các đối tượng khỏe mạnh ($n = 8$), bệnh nhân suy gan có AUC, $C_{\max}$ và $T_{\max}$ tăng khoảng 70% sớm hơn 40 phút so với người khỏe mạnh.

Chưa nghiên cứu dược động học của sumatriptan ở bệnh nhân suy gan nặng. Chống chỉ định sử dụng sumatriptan trong nhóm đối tượng này.

Bệnh nhân nam và nữ

Trong một thử nghiệm so sánh giữa nam và nữ, không quan sát thấy sự khác biệt về dược động học giữa các giới tính đối với AUC, $C_{\max}$, $T_{\max}$ và thời gian bán thải.

Chủng tộc

Độ thanh thải toàn thân và $C_{\max}$ của sumatriptan tiêm dưới da là tương tự ở các đối tượng nam khỏe mạnh da đen ($n = 34$) và da trắng ($n = 38$). Chưa đánh giá sự khác biệt giữa các chủng tộc khi dùng sumatriptan đường uống.

Các nghiên cứu tương tác thuốc

Chất ức chế monoamine oxidase-A

Điều trị bằng thuốc ức chế MAO-A thường dẫn đến tăng nồng độ sumatriptan trong huyết tương.

Do các tác dụng chuyển hóa lần đầu ở ruột và gan, sự gia tăng nồng độ toàn thân sau khi dùng đồng thời thuốc ức chế MAO-A với sumatriptan đường uống lớn hơn sau khi dùng đồng thời thuốc ức chế MAO với sumatriptan tiêm dưới da.

Trong một thử nghiệm trên 14 phụ nữ khỏe mạnh, điều trị trước với chất ức chế MAO-A làm giảm độ thanh thải của sumatriptan tiêm dưới da, dẫn đến tăng gấp 2 lần diện tích dưới đường cong nồng độ sumatriptan trong huyết tương theo thời gian (AUC), tương ứng với tăng 40% thời gian bán thải.

Một thử nghiệm nhỏ đánh giá hiệu quả của việc điều trị trước bằng chất ức chế MAO-A đối với sinh khả dụng của 25 mg sumatriptan đường uống dẫn đến nồng độ toàn thân tăng khoảng 7 lần.

Rượu

Uống rượu 30 phút trước khi uống sumatriptan không ảnh hưởng đến dược động học của sumatriptan.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI

Hộp 3 vỉ x 10 viên.

BẢO QUẢN

Bảo quản trong bao bì kín, nơi khô ráo, nhiệt độ dưới 30°C.

TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG

Nhà sản xuất.

HẠN DÙNG

36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Số lô sản xuất (Batch No.), ngày sản xuất (Mfg. date), hạn dùng (Exp. date): xin xem trên nhãn bao bì.

Cơ sở sản xuất:

Công ty TNHH Sinh Dược phẩm Hera

Lô A17, Khu công nghiệp Tứ Hạ, phường Tứ Hạ, thị xã Hương Trà, tỉnh Thừa Thiên Huế, Việt Nam.

